

Impedil[®]

Celecoxib

COMPOSICION

Cada cápsula contiene:

Celecoxib 200 mg y 400 mg, respectivamente
Excipientes, c.s.

PROPIEDADES

Es una droga antiinflamatoria no esteroide que presenta actividad antiinflamatoria, analgésica y antipirética en modelos animales. Se cree que su mecanismo de acción se debe a la inhibición de la síntesis de prostaglandinas, principalmente mediante la inhibición de la ciclooxigenasa2 (COX2) y, a concentraciones terapéuticas en seres humanos. Este no inhibe la isoenzima ciclooxigenasa1 (COX1), por lo tanto no interfiere en la síntesis de prostaglandinas protectoras gastrointestinales.

FARMACOCINETICA

Los niveles plasmáticos pico se alcanzan aproximadamente 3 horas después de la administración de una dosis oral. Tanto los niveles plasmáticos pico (C_{max}) como el área bajo la curva (ABC) son someramente proporcionales a la dosis en todo el rango de dosis clínicas de 100200 mg que se han estudiado. Con dosis múltiples, las condiciones de estado estable se alcanzan como máximo en o antes del quinto día. En voluntarios sanos, tiene un alto grado de unión a las proteínas (~97%) dentro del rango de dosis clínicas. Los estudios in vitro indican que se une principalmente a la albúmina y, en menor grado, a las 1 glicoproteínas ácidas. El volumen de distribución aparente en estado estable (V_{ss}/F) es de aproximadamente 400 L, lo cual sugiere una amplia distribución a nivel tisular. Su metabolismo se realiza principalmente a través del citocromo P450 2 C9. Se han identificado en el plasma humano tres metabolitos: un alcohol primario, el correspondiente ácido carboxílico y su conjugado glucurónico. Estos metabolitos son inactivos como inhibidores de la COX-1 o de la COX-2. Se elimina principalmente mediante el metabolismo hepático con un escaso porcentaje (<3%) de la droga recuperado en la orina y en las heces. La vida media efectiva es de aproximadamente 11 horas en condiciones de ayuno. El clearance plasmático aparente (CL/F) es de 50 mL/min. aproximadamente.

TOXICOLOGIA

No se encontró evidencia de carcinogenicidad ni mutagenicidad y no produjo alteraciones en la fertilidad en las diversas pruebas con animales y de laboratorio realizadas.

Efectos teratogénicos: no fue teratogénico en conejos hasta una dosis oral de 60 mg/kg/día (igual a la exposición humana a 200 mg dos veces al día en base al área bajo la curva 0-24 (ABC0-24); sin embargo a dosis orales 150 mg/kg/día (aproximadamente 2 veces la exposición humana a 200 mg dos veces al día según el ABC0-24), se observó una mayor incidencia de alteraciones fetales tales como costillas fusionadas, esternebras fusionadas y esternebras malformadas. Se observó un aumento dependiendo de la dosis en la incidencia de hernias diafragmáticas en uno de los dos estudios realizados con ratas a dosis orales 30 mg/kg/día (aproximadamente 6 veces la exposición humana en base al ABC0-24 a 200 mg dos veces al día).

Efectos no teratogénicos: produjo pérdidas pre-implantación y post-implantación y una reducción en la sobrevivencia embrionaria/fetal en las ratas a las que se le administraron dosis orales 50 mg/kg/día (aproximadamente 6 veces la exposición humana basado en el ABC0-24 a 200 mg dos veces al día). Estas son alteraciones de esperar debido a la inhibición de la síntesis de las prostaglandinas y no son como resultado de la alteración permanente de la función reproductiva de las hembras como tampoco son de esperar a niveles clínicos de exposición. No se han realizado estudios para evaluar su efecto sobre el cierre del conducto arterioso en seres humanos.

INFORMACION CLINICA

INDICACIONES

Está indicado para el alivio de los signos y síntomas de la osteoartritis y de la artritis reumatoidea en pacientes adultos, tales como dolor, sensibilidad e inflamación. Dismenorrea primaria.

ODONTOLOGIA

Prevención y tratamiento de cuadros dolorosos o inflamatorios por: Cirugías, fracturas dental o maxilar, exodoncias, pulpitis, lesiones de partes blandas.

CONTRAINDICACIONES

Está contraindicado en aquellos pacientes con hipersensibilidad demostrada a esta sustancia. No debe administrarse a pacientes que hubieran manifestado reacciones de tipo alérgico a las sulfonamidas. No debe administrarse a los pacientes que hubieran padecido asma, urticaria o reacciones de tipo alérgico después de haber tomado aspirina u otros AINES. No debe administrarse a los pacientes con triada de aspirina. Este complejo de síntomas se observa típicamente en los pacientes asmáticos que padecen rinitis, con o sin pólipos nasales, o que presentan broncoespasmos severos y potencialmente fatales después de tomar aspirina u otros AINES. En dicho grupo de pacientes se han informado casos de reacciones anafilácticas severas, aunque raramente fatales para los AINES.

EFFECTOS INDESEABLES

Los siguientes efectos indeseables ocurrieron, independientemente de la causalidad, en 0.1-1.9% de los pacientes.

Gastrointestinales: constipación, diverticulitis, disfgia, eructación, esofagitis, gastritis, gastroenteritis, reflujo gastroesofágico, hemorroides, hernia hiatal, melena, estomatitis, trastornos dentales, vómitos.

Cardiovasculares: hipertensión agravada, sequedad bucal, glaucoma, tenesmo.

Generales: alergia agravada, reacción alérgica, astenia, dolor de pecho, quiste no especificado, edema generalizado, edema facial, fiebre, acaloramiento, síntomas gripales, dolor, dolor periférico.

Sistema Nervioso Central y Periférico: calambres en las extremidades, hipertonia, hipoestesia, migraña, neuralgia, neuropatía, parestesia, vértigo.

Musculoqueléticos: artralgia, artrosis, trastornos óseos, fractura accidental, mialgia, rigidez de cuello, sinovitis, tendinitis.

Respiratorios: bronquitis, broncoespasmo, broncoespasmo agravado, tos, disnea, laringitis, neumonía.

PRECAUCIONES

Los pacientes con síntomas y/o signos que sugieran una disfunción hepática o que hubieran tenido alguna anomalía en los resultados del hepatograma deberán ser sometidos a un monitoreo exhaustivo para detectar el desarrollo de una reacción hepática más severa durante este tratamiento. Si se desarrollan signos o síntomas consistentes con enfermedad hepática, o si se producen manifestaciones sistémicas (por ej. eosinofilia, rash, etc.) deberá suspenderse su administración. Se deberá tener precaución cuando se comience el tratamiento en pacientes con una deshidratación considerable. Es recomendable rehidratar a los pacientes antes de comenzar el tratamiento. Asimismo se recomienda tener precaución con los pacientes con enfermedad renal

CAPSULAS

ANTIINFLAMATORIO Y ANALGESICO NO GASTROLESIVO

preexistente y con retención de líquido, hipertensión o insuficiencia cardíaca. No deberá administrarse a los pacientes con asma que son sensibles a la aspirina y se deberá usar con precaución en los pacientes con asma preexistente.

USO EN EMBARAZO Y LACTANCIA

No se han realizado estudios con mujeres embarazadas. Solo deberá utilizarse durante el embarazo cuando el beneficio justifique los potenciales riesgos para el feto. Se debe evitar el uso del producto al final del embarazo ya que puede producir el cierre prematuro del conducto arterioso.

Se excreta en la leche de ratas en periodo de lactancia a concentraciones similares a las plasmáticas. Se desconoce si esta droga se excreta en la leche humana. Debido a que muchas drogas se excretan en la leche humana y a causa de las potenciales reacciones adversas severas que esto podría producir en los lactantes, deberá adoptarse la decisión de suspender la lactancia o de suspender la droga, tomando en cuenta la importancia que la droga posea para la madre.

INTERACCIONES

Pueden producirse interacciones de significación cuando se administra junto con otras drogas que inhiben el citocromo P450 2 C9.

Estudios clínicos realizados con el mismo han permitido identificar interacciones de potencial significación con fluconazol y litio. La administración concomitante de fluconazol 200 mg diarios provocó un aumento dos veces mayor en su concentración. El tratamiento deberá comenzar a la mínima dosis recomendada en aquellos pacientes tratados con fluconazol. Los pacientes tratados con litio deberán ser sometidos a un estricto control cuando se inicie o se suspenda el tratamiento con esta droga. Puede utilizarse con dosis reducidas de aspirina; sin embargo, la administración concomitante con la aspirina puede aumentar los índices de ulceración gastrointestinal y de otras complicaciones en comparación con el uso solo. Debido a su ausencia de efectos plaquetarios, no es un sustituto de la aspirina para la profilaxis cardiovascular.

SOBREDOSIS

En casos de sobredosis de un AINE, los pacientes deberán ser tratados mediante cuidados sintomáticos y de sostén. No hay antidotos específicos. No se dispone de información sobre la eliminación del mismo mediante hemodiálisis, pero en base a su alto grado de unión a las proteínas plasmáticas (~97%) es improbable que la diálisis sea de utilidad en los casos de sobredosis. Se pueden indicar emesis y/o carbón activado (60 a 100 g en pacientes adultos, 1 a 2 g/kg en pacientes pediátricos) y/o catarsis osmótica dentro de las 4 horas de ingestión con síntomas o después de una sobredosis importante. La diuresis forzada, la alcalinización de la orina, la hemodiálisis o la hemoperfusión pueden no resultar de utilidad debido al alto grado de unión a las proteínas.

ADVERTENCIAS

En cualquier momento, con o sin síntomas previos, puede producirse toxicidad gastrointestinal severa del tipo de hemorragia, ulceración y perforación del estómago, del intestino delgado o del intestino grueso, en los pacientes tratados con drogas antiinflamatorias no esteroideas (AINES). Por lo tanto los médicos y los pacientes deben estar alerta a las ulceraciones y hemorragias, aún cuando no existieran antecedentes de síntomas gastrointestinales previos. La mayoría de los reportes espontáneos de reacciones gastrointestinales fatales se han registrado en pacientes de edad avanzada o debilidades por lo cual se debe tener especial precaución en el tratamiento de esta población.

USO Y DOSIS

Este producto puede administrarse sin tomar en consideración el horario de las comidas. La dosis normal recomendada es de 200 mg- 400 mg al día en una o dos dosis.

VIA DE ADMINISTRACION

Oral.

Antes de consumir este o cualquier otro medicamento, debe siempre consultar a su médico.

En caso de un marcado efecto secundario, sea este por sobredosis o reacción particular, acuda inmediatamente a su médico.

INFORMACION FARMACEUTICA

DURACION DE ESTABILIDAD

Verificar fecha de vencimiento señalada en el envase.

PRECAUCIONES ESPECIALES PARA SU CONSERVACION

Conservar a una temperatura menor o igual a los 30°C.

PRESENTACION

Caja conteniendo 2 tirillas de 6 cápsulas.

Caja conteniendo 5 tirillas de 6 cápsulas para detallar.

NOTA IMPORTANTE

Este producto se encuentra envasado y protegido en una adecuada y rigurosa laminación, especialmente diseñada para evitar su exposición con la luz y humedad, descartando además que por descuidos involuntarios los niños puedan acceder al mismo.

NUMEROS DE REGISTRO SANITARIO

Cápsulas de 200 mg: 2001-0263

Cápsulas de 400 mg: 2004-1257

Registro Industrial No. 14109

Venta por receta médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Fabricado por Ethical Pharmaceutical, S.R.L.
de República Dominicana.